

Substituted imidazo[1,5-A]pyridin derivatives as aromatase inhibitors**Patent**Number: ☐ [US4617307](#)Publication
date:

1986-10-14

Inventor(s): BROWNE LESLIE J (US)

Applicant(s): CIBA GEIGY CORP (US)

RequestedPatent: ☐ [EP0165904](#), [A3](#), [B1](#)**Application**

Number: US19840622421 19840620

Priority

Number(s): US19840622421 19840620



IPC

Classification: A61K31/44; C07D471/04

ECClassification: [C07D471/04](#), [C07D213/55](#), [C07D213/84E](#), [C07D233/54C2D1](#), [C07D233/54C2D2](#),
[C07D233/54C2D5](#), [C07D487/04](#), [C07F7/10](#), [C07F7/18C4D4D](#)

Equivalents: [AU4385785](#), [AU589565](#), ☐ [BG60262](#), ☐ [BG60305](#), ☐ [BG60306](#), ☐ [BG60307](#),
☐ [BG60352](#), ☐ [BG60353](#), ☐ [BG60402](#), [CA1276633](#), [CS8504449](#), [CY1750](#),
☐ [DD237510](#), [DE3582452D](#), ☐ [DK170302B](#), ☐ [DK277685](#), ☐ [ES8702406](#),
☐ [ES8800681](#), ☐ [ES8801262](#), ☐ [ES8802048](#), ☐ [ES8802049](#), ☐ [ES8802155](#),
☐ [FI80694B](#), ☐ [FI80694C](#), [FI852399](#), ☐ [GR851487](#), [HK23494](#), [HU37936](#), ☐ [IE58070](#),
[IL75546](#), [JP1724559C](#), [JP4007746B](#), ☐ [JP61012688](#), [KR9008566](#), [MX9203369](#),
[NO162467B](#), [NO162467C](#), [NO852474](#), [NZ212483](#), [PH23390](#), [PL145103B](#), [PL145104B](#),
[PL145105B](#), [PL145348B](#), [PL145814B](#), [PL254099](#), ☐ [PT80661](#), [RO92583](#), ☐ [SU1433413](#),
[SU1436878](#), [SU1436879](#), [SU1436880](#), ☐ [SU1443802](#), ☐ [SU1482530](#), [ZA8504615](#)

Abstract

Compounds of the formula  (Ia) wherein R1 represents cyano, nitro or C1-C4-alkyl or the 7,8-dihydro derivative thereof or the 5,6,7,8 tetrahydro derivative of the formula  (Ib) wherein R1 is as defined under formula Ia and R2 is hydrogen, C1-C4-alkyl, halogen etherified or esterified hydroxy or mercapto, carboxy-C1-C4-alkyl or C1-C4-alkoxycarbonyl-C1-C4-alkyl or C1-C4-alkanoyl, to stereoisomers, mixtures of these stereoisomers and salts of these compounds are disclosed as well as their preparation, pharmaceutical compositions containing the same and the use thereof as inhibitors of aromatase activity.

Data supplied from the esp@cenet database - I2



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets



Veröffentlichungsnummer: **0 165 904 B1**

12

EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

49 Veröffentlichungstag der Patentschrift: **10.04.91**

21 Anmeldenummer: **85810279.1**

22 Anmeldetag: **17.06.85**

51 Int. Cl.⁵: **A61K 31/435**, A61K 31/415,
A61K 31/55, A61K 31/395,
C07D 471/04, C07D 487/04,
/(C07D471/04,235:00,221:00),
(C07D487/04,235:00,209:00),
(C07D487/04,235:00,223:00)

94 Substituierte bicyclische Verbindungen.

30 Priorität: **20.06.84 US 622421**

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung:
27.12.85 Patentblatt 85/52

45 Bekanntmachung des Hinweises auf die
Patenterteilung:
10.04.91 Patentblatt 91/15

84 Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

56 Entgegenhaltungen:
EP-A- 0 068 386
EP-A- 0 114 573

Brodie et al, Endocrinology, vol.104, pp
118-121,(1979)

Camacho et al., JAMA, vol. 202, pp 114-120
(1967)

Foster et al., Journal Med. Chem., vol. 26, pp.

50-54 (1983)

73 Patentinhaber: **CIBA-GEIGY AG**
Klybeckstrasse 141
CH-4002 Basel(CH)

72 Erfinder: **Browne, Leslie J. Dr.**
41 Malapardis Road
Morris Plains New Jersey 07950(US)

EP 0 165 904 B1

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).